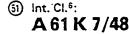


# (9) BUNDESREPUBLIK DEUTSCHLAND







® EP 0 559 786 B1



## DEUTSCHES PATENTAMT

## <sub>®</sub> DE 691 11 466 T 2

 (21) Deutsches Aktenzeichen:
 691 11 466.8

 (86) PCT-Aktenzeichen:
 PCT/US91/08898

 (86) Europäisches Aktenzeichen:
 92 901 503.0

(ii) PCT-Veröffentlichungs-Nr.: WO 92/09264(iii) PCT-Anmeldetag: 25. 11. 91

Weröffentlichungstag
der PCT-Anmeldung: 11. 6. 92

87 Erstveröffentlichung durch das EPA: 15. 9. 9387 Veröffentlichungstag

der Patenterteilung beim EPA: 19. 7. 95

(4) Veröffentlichungstag im Patentblatt: 4. 4. 96

30 Unionspriorität: 22 33 31

30.11.90 US 621166 30.11.90 US 621167

(3) Patentinhaber: Richardson Vicks, Inc., Shelton, Conn., US

(74) Vertreter: TER MEER-MÜLLER-STEINMEISTER & Partner, Patentanwälte, 81679 München

Benannte Vertragstaaten:
 DE, ES, FR, GB, IT

#### (72) Erfinder:

TURNER, Deborah Jean, Naugatuck, CT 06770, US; FOLEY, Jeanne Marie, West Haven, CT 06516, US; MEHTA, Arvind Mansukhlal, Woodbridge, CT 06525, US; DOUGHTY, Darrell Gene, Shelton, CT 06484, US

(S) EMULSION ZUR PFLEGE DER GESICHTSHAUT.

Anmerkung: Innerhalb von neun Monaten nach der Bekanntmachung des Hinweises auf die Erteilung des europäischen Patents kann jedermann beim Europäischen Patentamt gegen das erteilte europäische Patent Einspruch einlegen. Der Einspruch ist schriftlich einzüreichen und zu begründen. Er gilt erst als eingelegt, wenn die Einspruchsgebühr entrichtet worden ist (Art. 99 (1) Europäisches Patentübereinkommen).

Die Übersetzung ist gemäß Artikel II § 3 Abs. 1 IntPatÜG 1991 vom Patentinhaber eingereicht worden. Sie wurde vom Deutschen Patentamt inhaltlich nicht geprüft.

#### Übersetzung des Europäischen Patents Nr. 0 559 786 Europäische Patentanmeldung Nr. 92 901 503.0 RICHARDSON-VICKS, INC.

Case: 4301X

Me/AR

Die vorliegende Erfindung betrifft daraufbleibende Gesichtsemulsionszusammensetzungen, welche kationische Tenside und nicht flüchtige Organopolysiloxane enthalten und welche auch im wesentlichen frei sind an Fetten und Ölen und anionischen Tensiden; die zur Verbesserung des Aussehens der Haut durch Regulierung der Sebumverteilung auf der Hautoberfläche nützlich sind.

Sebum oder Hautöl wird in den im Haarfollikel- bzw. Talgdrüsenapparat der Haut sich befindenden Talgdrüsen produziert und erreicht die Hautoberfläche durch den Gang der Haarfollikel. Die Gegenwart überschüssiger Mengen von Sebum auf der Hautoberfläche führt oft zu einem unattraktiven, kosmetischen Zustand, welcher im allgemeinen als "fettige Haut" bekannt ist. Sebum spielt auch eine wichtige Rolle bei der Pathogenese von Akne. Die Talgdrüsenaktivität ist bei Aknepatienten erheblich erhöht und Individuen mit der schwersten Form der Akne weisen oft die höchsten Sebumsekretionsraten auf.

Die Ausbreitung von Sebum auf der Hautoberfläche ist folglich ein wichtiger kosmetischer Parameter, da seine Verteilung auf der Hautoberfläche das Auftreten von Fettigkeit oder Öligkeit bestimmen und zur Schwere der Akne beitragen kann.

15

20

25

30

Es ist deshalb vorteilhaft, ein Mittel zur Regulierung der Verteilung von Sebum über die Oberfläche der menschlichen Haut zur Verfügung zu haben, unter besonderer Berücksichtigung von Haut, welche durch eine überschüssige Sekretion oder ein überschüssiges Vorhandensein von Sebum auf der Oberfläche gekennzeichnet ist, und zur Beeinflussung von Hautbereichen von zum Beispiel Aknepatienten.

Gegenwärtig auf dem Markt befindliche, daraufbleibende Gesichtsemulsionsprodukte regulieren die Verteilung von Sebum auf der Hautoberfläche nicht wirksam. Ohne an die Theorie gebunden zu sein, nimmt man an, daß gegenwärtige daraufbleibende Emulsionsprodukte unerwünschterweise die Oberflächeneigenschaften der Haut verändern und auf diese Weise den Kontaktwinkel des Sebums mit der Haut vergrößern und so seine Ausbreitung verhindern. Diese Produkte bewirken, daß sezemiertes Sebum als kleine diskrete Tröpfchen auf der Haut verbleibt, was zu einer fettigen Haut und den damit verbundenen Problemen führt.

Üblicherweise wurde das Problem der fettigen Gesichtshaut durch häufige Reinigung und die Verwendung von adstringierenden Präparaten behandelt. Jedoch sind solche Mittel

von Austrocknung, Reizung und Schädigung der Haut auf. Zusätzlich ist jeder durch Reinigung und die Verwendung von adstringierenden Mitteln erzielte Nutzen nur vorübergehend. Nachdem die Haut vom Sebum gereinigt wurde, beginnt die Haut von neuem Sebum zu sezernieren, so daß das Problem der fettigen Haut bald wiederkehrt.

Der Stand der Technik lehrt das Einbringen von Tonen, Talken, Silikaten, Stärken, Polymeren und von anderen solchen Stoffen in Hautschutzprodukte zur Absorption von Sebum und zur Regulierung von fettiger Haut. Vgl. US-A-4,940,578, Yoshihara T. et al., erteilt am 10. Juli 1990; US-A-4,885,109 von Umemoto I. et al., erteilt am 5. Dezember 1989; US-A-4,536,399 von Flynn R.G. et al., erteilt am 20. August 1985; US-A-4,489,058 von Lay G.E. et al., erteilt am 18. Dezember 1984; US-A-4,388,301 von Klein 10 R.W., erteilt am 14. Juni 1983 und US-A-4,000,317 von Menda W.C. et al., erteilt am 28. Dezember 1976. Jedoch wird die Durchführbarkeit des Einbringens von Sebumabsorbierenden Stoffen durch das Sebumabsorptionsvermögen des Stoffs, der Zubereitungsschwierigkeiten und der negativen ästhetischen Eigenschaften, welche diese Stoffe den fertigen Produkten verleihen, begrenzt. Auch ist jeder erzielbare Fettregulierungsvor-15 teil nur vorübergehend.

Es wird angenommen, daß ein länger anhaltendes Verfahren zur Verminderung von Sebum auf der Haut durch die Anwendung von topischen oder systemischen Mitteln eine die Talgbildung hemmende Wirkung bereitstellt. Vgl. Karg G. et al., "Sebosuppression", Cosmetics & Toiletries, Bd. 102 (April 1987), 140-146; US-A-4,593,021 von Hsia S.L. et 20 al., erteilt am 3. Juni 1986; US-A-4,587,235 von Bittler D. et al., erteilt am 6. Mai 1986; US-A-4,529,587 von Green M.R., erteilt am 16. Juli 1985; US-A-4,210,654 von Bauer et al., erteilt am 1. Juli 1980 und US-A-4,016,287 von Eberhardt et al., erteilt am 5. April 1977. Ohne an die Theorie gebunden zu sein, nimmt man an, daß die Talgbildung hemmende Mittel die Sebumproduktion der Talgdrüsengänge der Haut verringern und dadurch die Oberflächenfettigkeit vermindern. Jedoch sind viele, die Talgbildung hemmende Mittel wirksame Arzneimittel mit unerwünschten Nebenwirkungen auf die diuretische Aktivität, Entzündungsvermittler, Blutdruck, Hormonspiegel, Cholesterinsynthese und andere Körperfunktionen. So kann die Anwendung der die Talgbildung hemmenden Mittel zur Regulierung fettiger Haut nicht immer durchführbar, wünschenswert oder auch 30 möglich sein.

Die Regulierung der Sebumausbreitung über topische Zubereitungen, welche keine die Talgbildung hemmende Mittel enthalten, wird in der AU-A-8,319,558 von Herstein et al., veröffentlicht am 12. April 1984, beschrieben. Dieses Patent offenbart Zubereitungen für die Anwendung auf fettige Haut, wie Reinigungsmittel, Shampoos und Anti-Akne-

15

25

30

Medikamente, welche Gluconamidopropyldimethyl-2-hydroxyethylammoniumchlorid enthalten. Jedoch weisen diese Zubereitungen die unerwünschte Eigenschaft auf, daß sie den Kontaktwinkel von Sebum mit der Haut vergrößern und sogar die Ausbreitung und Verteilung des Sebums hemmen. Auch sind keine der offenbarten Zubereitungen daraufbleibende, emulsionsähnliche Lotionen oder Cremen.

Außerdem, zusätzlich zu den vorstehend diskutierten Beschränkungen des Stands der Technik, tragen die meisten gegenwärtig auf dem Markt befindlichen Emulsionsprodukte eigentlich zu den Problemen fettiger Haut bei und verschlimmern sie. Die meisten Emulsionsprodukte sind Öl-in-Wasser- oder Wasser-in-Öl-Emulsionen, welche große Mengen von Fetten und Ölen enthalten. Die großen Mengen von Fetten und Ölen in diesen Produkten verleiht ihnen ihre charakteristische fettige und ölige Ästhetik und trägt zu den Problemen fettiger Haut bei. Die begrenzte Anzahl von Produkten, für die beansprucht wird, daß sie frei an Fetten und Ölen sind, sind üblicherweise keine emulsionsähnlichen Produkte, sind aber statt dessen Wasser-Alkohol-Zubereitungen von geringer Viskosität, welche zu sauer und zu adstringent für die regelmäßige oder häufige Anwendung sind.

Andere kosmetische Zusammensetzungen werden zum Beispiel in der US-A-4,387,019 von Georgalas et al., erteilt am 16. Juni 1989, und auch in der US-A-4,863,725 von Deckner et al., erteilt am 5. September 1989, offenbart. Die EP-A-0,330,369 offenbart Hautkonditionierungszusammensetzungen.

20 Deshalb wäre es sehr wünschenswert, daraufbleibende Gesichtsemulsionszusammensetzungen zu entwickeln, welche die Nachteile des Stands der Technik überwinden.

Deshalb ist es ein Ziel der vorliegenden Erfindung daraufbleibende Gesichtsemulsionszusammensetzungen bereitzustellen, welche das fettige Aussehen und das ölige Gefühl
der Gesichtshaut vermindern. Ein anderes erfindungsgemäßes Ziel ist die Bereitstellung
von Zusammensetzungen zur Regulierung der Verteilung von Sebum auf der Hautoberfläche. Ein weiteres erfindungsgemäßes Ziel ist die Bereitstellung von Zusammensetzungen, welche ästhetisch angenehm und im wesentlichen frei an Fetten und Ölen und
anionischen Tensiden sind. Ein anderes erfindungsgemäßes Ziel ist die Bereitstellung von
Zusammensetzungen zur Regulierung der Sebumverteilung ohne Beimischung von ölabsorbierenden Stoffen. Ein weiteres erfindungsgemäßes Ziel ist die Bereitstellung von
Zusammensetzungen zur Regulierung der Sebumverteilung ohne die Verwendung von die
Talgbildung hemmenden Mitteln. Ein weiteres erfindungsgemäßes Ziel ist auch die
Bereitstellung von Zusammensetzungen, welche den Kontaktwinkel zwischen Sebum und
Haut verringern. Ein anderes Ziel der vorliegenden Erfindung ist die Bereitstellung von

teilen. Ein weiteres erfindungsgemäßes Ziel ist das erneute Fetten der Haut durch Sebum aufzuhalten. Ein anderes erfindungsgemäßes Ziel ist die Bereitstellung von Verfahren zur Verminderung des fettigen Aussehens und des öligen Gefühls auf der Gesichtshaut.

Diese und andere Ziele dieser Erfindung werden aus der folgenden Offenlegung deutlich.

- Die vorliegende Erfindung betrifft eine daraufbleibende Gesichtsemulsionszusammensetzung, welche frei an Fetten und Ölen und anionischen Tensiden ist, umfassend:
  - (a) 0,01 bis 5 Gew.-% eines kationischen Tensids;
  - (b) 0,1 bis 10 Gew.-% eines Organopolysiloxans mit einem Durchschnittsmolekulargewicht von mindestens 200 000;
- 10 (c) 0,01 bis 5 Gew.-% eines oder mehrerer Carbonsäurepolymere;
  - (d) 1 bis 10 Gew.-% eines Feuchthaltemittels; und
  - (e) einen kosmetisch annehmbaren Träger.

Die vorliegende Erfindung betrifft außerdem Verfahren zur Regulierung der Verteilung von Sebum auf der Gesichtshaut.

15 Bestandteile werden durch ihre chemische oder CTFA-Bezeichnung angegeben.

Wenn nicht anders angegeben, sind alle hier verwendeten Prozentangaben und Verhältnisse Gewichtsangaben.

Wenn nicht anders angegeben, werden alle Messungen bei 25°C durchgeführt.

- Der hier zur Modifizierung des Begriffs "Gesichtsemulsionszusammensetzung" verwen20 dete Begriff "daraufbleibend" wird verwendet, um darauf hinzuweisen, daß die erfindungsgemäßen Zusammensetzungen für das Auftragen auf die Haut gedacht sind und auf
  der Haut verbleiben. Diese daraufbleibenden Zusammensetzungen sind von Zusammensetzungen zu unterscheiden, welche auf die Haut aufgetragen werden und nachfolgend
  entweder durch Waschen, Spülen, Abwischen oder ähnliches entfernt werden.
- Der Begriff "frei an Fetten und Ölen" bedeutet, daß die erfindungsgemäßen Zusammensetzungen keine Bestandteile enthalten, welche üblicherweise vom Fachmann als Fettund/oder Ölbestandteil angesehen werden. Genaugenommen werden Fette als natürlich vorkommende Ester langkettiger Carbonsäuren und Glycerin definiert, d.h. als Glycerin-

10

20

25

30

cherweise als Öle definiert. Diese Definitionen für Fette und Öle werden bei Streitwieser und Heathcock, Introduction to Organic Chemistry (1976), 506-509, beschrieben.

Der Begriff "frei an anionischen Tensiden" bedeutet, daß die erfindungsgemäßen Zusammensetzungen weniger als 1 Gew.-% eines anionischen Tensids und vorzugsweise kein anionisches Tensid enthalten.

Der Kontaktwinkel wird definiert als der innere Winkel zwischen einer Oberfläche und einem auf der Oberfläche ruhenden Flüssigkeitströpfehen. Große Kontaktwinkel entsprechen einer schlechten Benetzung der Oberfläche durch die Flüssigkeit, während kleine Kontaktwinkel eine gute Benetzung bedeuten. Wenn sich eine Flüssigkeit auf der Oberfläche ausbreitet, wird der Kontaktwinkel als Null angesehen und es erfolgt eine vollständige Benetzung. Kontaktwinkelmessungen können zur Bestimmung der Benetzbarkeit der menschlichen Haut durch eine Vielzahl von Flüssigkeiten verwendet werden. Diese Kontaktwinkel variieren von 0° für stark lipophile Stoffe, wie Mineralöl, bis zu 108° für Wasser und können mit einer Vielzahl von Techniken bestimmt werden. Vgl. Rosenberg A. et al., "Interaction Forces Involved in Wetting of Human Skin", Journal of Pharmaceutical Sciences, Bd. 62, Nr. 6 (Juni 1973), 920-921; Schott H. "Contact Angles and Wettability of Human Skin", Journal of Pharmaceutical Sciences, Bd. 60, Nr. 12 (Dezember 1971), 1893-1895, und Rosen M.J., Surfactants and Interfacial Phenomena, 2. Auflage (1989), 244-248.

Der Kontaktwinkel von Sebum mit Haut, welche mit den erfindungsgemäßen Zusammensetzungen behandelt wurde, kann mit verschiedenen in vivo-Techniken gemessen werden. Beispielsweise kann eine geeignete Stelle auf der Haut (wie Gesicht, Handrücken, Unterarm, etc.) gereinigt und mit der jeweiligen Emulsionszusammensetzung (etwa 2 mg/cm²) behandelt werden, gefolgt von dem Auftragen eines einzigen Tropfens Sebum. Nach etwa einer Minute kann der Kontaktwinkel des Sebums mit der Haut unter Verwendung eines Makroskops (Scopeman® MS503, erhältlich von Moritex USA, Inc., San Diego, CA) bei 25facher Vergrößerung direkt gemessen werden oder kann alternativ aus einer Videoaufnahme oder Photographie bestimmt werden. Bevorzugte Kontaktwinkel für Sebum mit Haut, welche mit den erfindungsgemäßen Emulsionen behandelt wurde, betragen vorzugsweise zwischen 0° und etwa 15°, stärker bevorzugt zwischen 0° und 12° und besonders bevorzugt zwischen 0° und etwa 10°.

Die Sebumausbreitung und die Wirkungen der Hautschutzprodukte auf diese Ausbreitung kann durch verschiedene in vivo-Techniken bestimmt werden. Beispielsweise kann eine geeignete Stelle auf der Haut (wie das Gesicht, Handrücken, Unterarm, etc.) gereinigt und

20

25

30

gefolgt von dem Auftragen eines einzigen Tropfens Sebum. Die Ausbreitung des Sebums kann durch die Messung des Oberflächenbereichs des Sebums als eine Funktion der Zeit direkt bestimmt werden oder aus Videoaufnahmen oder Photographien des Sebums, welche in geeigneten Zeitintervallen aufgenommen wurden. Die Bereiche können entweder in absoluten Einheiten (z.B. cm<sup>2</sup>, mm<sup>2</sup>) oder in anderen relativen Einheiten (z.B. die Anzahl von Bildpunkten auf einer Videokathodenstrahlröhre) gemessen werden. Ein Bildpunkt ist ein einzelnes Element, welches ein Bild auf einem Videokathodenstrahlröhrenbildschirm aufbaut.

Beispielsweise stellte man fest, daß es zur Bestimmung der Sebumausbreitungsgeschwindigkeiten besonders günstig ist, die Geschwindigkeit als Veränderung in dem Bereich in Bildpunkten pro Zeiteinheit in Minuten zu messen. Die Geschwindigkeit der Sebumausbreitung wird besonders günstig in Bildpunkten pro Zeitintervallen von 5 Minuten aufgezeichnet.

Die bevorzugte Geschwindigkeit der Sebumausbreitung für die erfindungsgemäßen Emulsionen ist größer als etwa 8300 Bildpunkte über einen Zeitraum von 0 bis 5 Minu-15 ten. Eine stärker bevorzugte Geschwindigkeit ist größer als etwa 8500 Bildpunkte über einen Zeitraum von 0 bis 5 Minuten. Eine sogar stärker bevorzugte Geschwindigkeit ist größer als etwa 8700 Bildpunkte über einen Zeitraum von 0 bis 5 Minuten. Ein weitere, sogar stärker bevorzugte Geschwindigkeit ist größer als etwa 9000 Bildpunkte über einen Zeitraum von 0 bis 5 Minuten. Die am meisten bevorzugte Geschwindigkeit ist größer als etwa 9500 Bildpunkte über einen Zeitraum von 0 bis 5 Minuten.

Die erfindungsgemäßen Emulsionszusammensetzungen sind vom Öl-in-Wasser-Typ, da diese bessere ästhetische Eigenschaften bereitstellen. Die Emulsionen werden unter Anwendung von auf dem Fachgebiet bekannten Prinzipien und Methodiken durch Vermischen der Bestandteile und durch Auswählen der zu verwendenden Art der Mischapparatur leicht hergestellt. Abhängig von der Auswahl der Bestandteile weist die Zubereitung eine halbfeste cremeähnliche Konsistenz auf, welche in eine Plastikdrücktube oder in ein Glasgefäß verpackt werden kann, oder sie besitzt eine lotionsähnliche Konsistenz, welche in einen Plastikdrückbehälter oder in eine Flasche verpackt werden kann. Der Behälter kann einen Ausgießdeckel oder einen Pumpspender einschließen.

Die wesentlichen Bestandteile dieser Emulsionen schließen die folgenden ein.

Ein wesentlicher Bestandteil der vorliegenden Zusammensetzungen ist ein kationisches Tensid, welches in der Emulsion in einer Konzentration von 0,01 bis 5 Gew.-% vorliegt, stärker hevorzugt in einer Konzentration von 0.01 bis 2 Gew.-% und besonders bevorzugt

10

25

in einer Konzentration von 0,01 bis 1 Gew.-%. McCutcheon, Detergents and Emulsifiers (1986), Nord-Amerika-Ausgabe, veröffentlicht von Allured Publishing Corporation, schließt eine große Liste kationischer Tenside ein.

Beispiele kationischer Tenside umfassen Distearyldimethylammoniumchlorid, Dilauryldimethylammoniumchlorid, N-Cetylpyridiniumbromid, Alkyldimethylethylbenzylammoniumcyclohexylsulfamat, Dodecyldimethylethylbenzylammoniumchlorid, Alkyltriethanolammoniumchlorid, Dimethyl-di(hydrierter Talg)-ammoniumchlorid, Quaternium-15, Bis-(hydrierter Talg-alkyl)-dimethylmethylsulfate, γ-Gluconamidopropyldimethyl-2-hydroxyethylammoniumchlorid, Decyldimethyloctylammoniumchlorid, 2-hydroxyethyl-Nerz-amidopropylammoniumchlorid, Quarternium-18-Methosulfat, Iso-Cocamidopropyldimethylacetamidoammododecylbenzyltriethanolammoniumchlorid, niumchlorid, Quarternium-45, Quarternium-51, Quarternium-52, Quarternium-53, Bis-600, Lanolin/Iso-(N-hydroxyethyl-2-oleyl-imidazoliniumchlorid)-polyethylenglykol steramidopropylethyldimethylammoniumethosulfat, Bis-[amidopropyl-(N,N-dimethyl-Nethyl)-ammoniummethosulfat]-dimersäure, Quarternium-62, Quarternium-63, Stearamidopropyldimethyl-(myristylacetat)-ammoniumchlorid und Quarternium-71. Diese hydrophoben kationischen Tenside können entweder einzeln oder als Kombination eines oder mehrerer Stoffe verwendet werden.

Die bevorzugten hydrophoben, kationischen Tenside für die erfindungsgemäße Anwendung sind Halogenidsalze der N,N,N-Trialkylaminoalkylenglukonamide mit der Formel

worin R = Alkyl, X-= Cl oder Br und n eine ganze Zahl von 2 bis 4 ist.

Für die erfindungsgemäße Anwendung wird Glukonamidopropyl-dimethyl-2-hydroxyethyl-ammoniumchlorid (CTFA-Bezeichnung Quarternium-22) besonders bevorzugt, welches die folgende Struktur besitzt: 10.

20

Diese Verbindung ist im Handel als freifließende, 60%ige wäßrige Lösung von Van Dyk, Inc. (Belleville, NJ) unter der Handelsmarke Ceraphyl® 60 erhältlich. US-A-3,855,290 von Zak et al., erteilt am 17. Dezember 1974; US-A-3,766,267 von Zak et al., erteilt am 16. Oktober 1973 und US-A-4,534,964 von Herstein et al., erteilt am 13. August 1985, beschreiben Quarternium-22 und seine Anwendung in Schutzprodukten für den Mensch weiter.

Ein anderer wesentlicher Bestandteil ist ein Organopolysiloxan mit einem Durchschnittsmolekulargewicht von mindestens 200 000, welches in einer Konzentration von 0,05 bis 10 Gew.-%, stärker bevorzugt in einer Konzentration von 0,1 bis 5 Gew.-% und besonders bevorzugt in einer Konzentration von 0,1 bis 1 Gew.-% vorliegt. Die Silikonkomponente ist gegenüber der Haut und gegenüber Säuren im sich erneut über die Oberfläche der Haut verteilenden Sebum beständig. Beispiele solcher Silikone umfassen Dimethiconcopolyol; Dimethylpolysiloxan; Diethylpolysiloxan; Dimethicon (Durchschnittsmolekulargewicht 200 000 bis 1 000 000 und vorzugsweise 300 000 bis 600 000), welches verschiedene Endgruppen aufweisen kann, wie eine Hydroxylgruppe, einen C1-C3-Niederalkylrest, einen C<sub>1-</sub>C<sub>3</sub>-Niederalkoxyrest und ähnliches; gemischtes C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-Alkylpolysiloxan (z.B. Methylethylpolysiloxan); Phenyldimethicon und andere Aryldimethicone; Dimethiconol und Gemische davon. Bevorzugt wird Dimethiconol, welches ein Dimethylsilikonpolymer mit Hydroxyl-Endgruppen ist. Dimethiconol ist als Q2-1401-Fluid erhältlich, eine Lösung mit 13% Dimethiconol mit extrem hoher Viskosität in einer flüchtigen Cyclomethiconflüssigkeit als Träger, und als Q2-1403-Fluid, eine Lösung von Dimethiconolflüssigkeit mit extrem hoher Viskosität in Dimethicon (beide werden durch die Dow Corning Corporation vertrieben).

Ein anderer wesentlicher Bestandteil der erfindungsgemäßen Zusammensetzungen ist ein Carbonsäurecopolymer. Diese Copolymere bestehen im wesentlichen aus einem kolloidalen, wasserlöslichen Polymer von Acrylsäure, vernetzt mit einem Polyalkenylpolyether eines mehrwertigen Alkohols und wahlweise mit einem Acrylatester oder einem polyfunktionellen Vinylidenmonomer.

15

20

25

Bevorzugte, erfindungsgemäß nützliche Copolymere sind Polymere eines Monomergemisches, enthaltend 95,9 bis 98,8 Gew.-% eines olefinischen, ungesättigten Carbonmonomers, ausgewählt aus der Acryl-, Methacryl- und Ethacrylsäuren umfassenden Gruppe; 1 bis 3,5 Gew.-% eines Acrylatesters der Formel

worin R ein Alkylrest mit 10 bis 30 Kohlenstoffatomen ist und R¹ ein Wasserstoffatom, eine Methyl- oder Ethylgruppe bedeutet; und 0,1 bis 0,6 Gew.-% eines polymerisierbaren, vernetzenden Polyalkenylpolyethers eines mehrwertigen Alkohols mit mehr als einer Alkenylethergruppe pro Molekül, wobei der mehrwertige Stammalkohol mindestens 3 Kohlenstoffatome und mindestens 3 Hydroxylgruppen enthält.

Vorzugsweise enthalten diese Polymere etwa 96 bis etwa 97,9 Gew.-% Acrylsäure und etwa 2,5 bis etwa 3,5 Gew.-% Acrylester, worin die Alkylgruppe 12 bis 22 Kohlenstoffatome enthält und R¹ eine Methylgruppe ist, besonders bevorzugt wird der Acrylatester Stearylmethacrylat. Vorzugsweise beträgt die Menge des vernetzenden Polyalkenylpolyethermonomers etwa 0,2 bis 0,4 Gew.-%. Die bevorzugten, vernetzenden Polyalkenylpolyethermonomere sind Allylpentaerythrit, Trimethylolpropandiallylether oder Allylsaccharose. Diese Polymere werden in der US-A-4,509,949 von Huang et al., erteilt am 5. April 1985, beschrieben.

Andere bevorzugte, erfindungsgemäß nützliche Copolymere sind Polymere, welche mindestens zwei monomere Bestandteile enthalten, wobei der eine Bestandteil eine monomere, olefinisch-ungesättigte Carbonsäure und der andere ein Polyalkenyl-polyether eines mehrwertigen Alkohols ist. In dem Monomergemisch können zusätzliche monomere Stoffe vorliegen, falls gewünscht, auch in einem überwiegenden Anteil.

Der erste monomere Bestandteil, welcher bei der Herstellung dieser Carbonpolymere nützlich ist, sind die olefinisch-ungesättigten Carbonsäuren, welche mindestens eine aktivierte, olefinische Kohlenstoff-zu-Kohlenstoff-Doppelbindung und mindestens eine Carboxylgruppe enthalten. Die bevorzugten Carbonmonomere sind Acrylsäuren mit der allgemeinen Struktur

20

worin R<sup>2</sup> eine Substituent ist, welcher aus der Wasserstoff, Halogen und Cyanogruppen (-C=N), einwertige Alkylreste, einwertige Alkarylreste und einwertige, cycloaliphatische Reste umfassenden Klasse gewählt ist. In dieser Klasse werden Acryl-, Methacryl- und Ethacrylsäure besonders bevorzugt. Ein anderes nützliches Carbonmonomer ist Maleinanhydrid oder die Säure davon. Die Menge der verwendeten Säure beträgt 95,5 bis 98,9 Gew.-% der insgesamt verwendeten Monomere. Stärker bevorzugt liegt die Menge im Bereich von 96 bis 97,9 Gew.-%.

Der zweite monomere Bestandteil, welcher bei der Herstellung dieser Carbonpolymere nützlich ist, umfaßt die Polyalkenylpolyether mit mehr als einer Alkenylethergruppierung pro Molekül. Die besonders nützlichen besitzen Alkenylgruppen, in welchen eine olefinische, an eine terminale Methylengruppierung gebundene Doppelbindung vorliegt (CH<sub>2</sub>=C<).

Zusätzliche monomere Stoffe, welche in den Polymeren vorliegen können, umfassen polyfunktionelle Vinylidenmonomere mit mindestens zwei CH<sub>2</sub><-Endgruppen, zum Beispiel einschließlich Butadien, Isopren, Divinylbenzol, Divinylnaphthalin, Allylacrylate und ähnliches. Diese Polymere werden in der US-A-2,798,053 von Brown H.P., erteilt am 2. Juli 1957, ausführlich beschrieben.

Beispiele von erfindungsgemäß nützlichen Carbonsäurecopolymeren umfassen Carbomer 934 (RTM), Carbomer 941 (RTM), Carbomer 950 (RTM), Carbomer 951 (RTM), Carbomer 951 (RTM), Carbomer 954 (RTM), Carbomer 980 (RTM), Carbomer 981 (RTM), Carbomer 1342 (RTM) und Acrylate/C<sub>10-30</sub>-Alkylacrylat-Vernetzungspolymere (erhältlich als Carbopol 934 (RTM), Carbopol 941 (RTM), Carbopol 950 (RTM), Carbopol 951 (RTM), Carbopol 954 (RTM), Carbopol 980 (RTM), Carbopol 981 (RTM) und Carbopol 1342 (RTM) bzw. die Pemulen-Reihe von Goodrich B.F.).

Acrylsäure/Acrylamidcopolymeren, welche durch die Hoechst Celanese Corporation unter der Handelsmarke Hostaceren PN73 vertrieben werden. Ebenfalls eingeschlossen sind die Hydrogelpolymere, welche durch die Lipo Chemicals Inc. unter der Handelsmarke HYPAN-Hydrogele vertrieben werden. Diese Hydrogele bestehen aus kristallinen Gruppierungen von Nitriten an einem C-C-Gerüst mit verschiedenen anderen darangebundenen Gruppen, wie Carboxylen, Amiden und Amidinen. Ein Beispiel schließt HYPAN-SA100-H ein, ein von Lipo Chemical erhältliches Polymerpulver.

25

Zur Neutralisierung von Copolymeren, welche eine saure Gruppe enthalten, nützliche Neutralisierungsmittel umfassen Natriumhydroxid, Kaliumhydroxid, Ammoniumhydroxid, Monoethanolamin, Diethanolamin, Triethanolamin, Tetrahydroxypropylethylendiamin (erhältlich als Quadrol® (RTM)-Reihe von BASF), Tris, Arginin, Triisopropylamin und Lysin.

Die Carbonsäurecopolymere können einzeln oder als Gemisch aus zwei oder mehreren Polymeren verwendet werden und umfassen 0,025 bis 0,75 Gew.-%, vorzugsweise 0,05 bis 0,25 Gew.-% und besonders bevorzugt 0,075 bis 0,175 Gew.-% der erfindungsgemä-Ben Zusammensetzungen.

Das Gewichtsverhältnis von Carbonsäurecopolymer zu kationischem Tensid beträgt für 10 die vorliegende Erfindung vorzugsweise etwa 1:10 bis etwa 10:1.

Der letzte wesentliche Bestandteil der erfindungsgemäßen Zusammensetzungen ist ein Feuchthaltemittel. Eine Vielzahl von Feuchthaltemitteln kann bei den erfindungsgemäßen Zusammensetzungen verwendet werden und kann in einer Menge von 1 bis 10 Gew.-%, 15 stärker bevorzugt in einer Menge von 2 bis 8 Gew.-% und besonders bevorzugt in einer Menge von 3 bis 5 Gew.-% vorliegen. Diese Feuchthaltemittel umfassen Harnstoff; Guanidin; Glykolsäure und Glykolatsalze (z.B. Ammonium und quartāres Alkylammonium); Milchsäure und Lactatsalze (z.B. Ammonium und quartäres Alkylammonium); Polyhydroxyalkohole, wie Sorbit, Glycerin, Hexantriol, Propylenglykol, Hexylenglykol und ähnliches; Polyethylenglykol; Zucker und Stärken; Zucker- und Stärkederivate (z.B. alkoxylierte Glukose); D-Panthenol; Hyaluronsäure; Lactamidmonoethanolamin; Acetamidmonoethanolamin; und Mischungen davon.

Bevorzugte Feuchthaltemittel für die Verwendung bei den erfindungsgemäßen Zusammensetzungen sind die C3-C6-Diole und -Triole. Insbesondere bevorzugt wird das Triol Glycerin.

Eine jede der Wasser- und Ölphasen der Öl-in-Wasser-Emulsion kann wahlweise Bestandteile enthalten, welche eine große Vielzahl von kosmetischen und pharmakologischen Zusätzen umfassen.

Eine große Vielzahl von einem oder mehreren herkömmlichen Sonnenschutzmitteln ist für die erfindungsgemäße Anwendung geeignet. Segarin et al., Cosmetics Science and 30 Technology, Kapitel VIII, 189ff, offenbaren mehrere geeignete Mittel. Spezifisch geeignete Sonnenschutzmittel umfassen zum Beispiel: Ethylhexyl-p-methoxyzinnamat

35

ihre Salze und Derivate (Ethyl-, Isobutyl-, Glycerylester; p-Dimethylaminobenzoesäure; 2-Ethylhexyl-N,N-dimethylaminobenzoat); Anthranilate (d.h. o-Aminobenzoate; Methyl-, Octyl-, Amyl-, Menthyl-, Phenyl-, Benzyl-, Phenylethyl-, Linalyl-, Terpinyl- und Cyclohexenylester); Salicylate (Octyl-, Amyl-, Phenyl-, Benzyl-, Menthyl-, Glyceryl- und Dipropylenglykolester); Zimtsäurederivate (Menthyl- und Benzylester, Phenylzimtsäure-5 nitril, Butylzimtsäurepyruvat); Dihydroxyzimtsäurederivate (Umbelliferon, Methylumbelliferon, Methylacetoumbelliferon); Trihydroxyzimtsäurederivate (Esculetin, Methylesculetin, Daphnetin und die Glukoside Esculin und Daphnin); Kohlenwasserstoffe (Diphenylbutadien, Stilben); Dibenzalaceton und Benzalacetophenon; Naphtholsulfonate (Natriumsalze von 2-Naphthol-3,6-disulfon- und 2-Naphthol-6,8-disulfonsäuren); Di-10 hydroxynaphthoesäure und ihre Salze; o- und p-Hydroxybiphenyldisulfonate; Cumarinderivate (7-Hydroxy, 7-Methyl, 3-Phenyl); Diazole (2-Acetyl-3-bromindazol, Phenylbenzoxazol, Methylnaphthoxazol, verschiedene Arylbenzothiazole); Chininsalze (Bisulfat, Sulfat, Chlorid, Oleat und Tannat); Chinolinderivate (8-Hydroxychinolinsalze, 2-Phenylchinolin); Hydroxy- oder Methoxy-substituierte Benzophenone; Harn- und 15 Violursäuren; Tanninsäure und ihre Derivate (z.B. Hexaethylether); (Butylcarbityl)-(6propyl-piperonyl)-ether; Hydrochinon; Benzophenone (Oxybenzol, Sulisobenzon, Dioxybenzon, Benzoresorcinol, 2,2',4,4'-Tetrahydroxybenzophenon, 2,2'-Dihydroxy-4,4'-dimethoxybenzophenon, Octabenzon); 4-Isopropyldibenzoylmethan; Butylmethoxydibenzoylmethan; Octocrylen; 4-Isopropyl-di-benzoylmethan und Kampferderivate, wie 20 Methylbenzyliden oder Benzylidenkampfer, und Mischungen davon. Andere Sonnenumfassen feste, physikalische Sonnenblocker, wie schutzmittel (mikronimiertes Titandioxid, 0,03 µm (Mikron)), Zinkoxid, Siliziumdioxyd, Eisenoxid und ähnliches. Ohne an die Theorie gebunden zu sein, nimmt man an, daß diese anorganischen Stoffe einen Sonnenschutzvorteil durch Reflektion, Streuung und 25 Absorption von schädlicher UV-Strahlung, Strahlung im sichtbaren und im Infrarotbereich bereitstellen.

In den erfindungsgemäßen Sonnenschutzmittelzusammensetzungen kann eine sichere und vor Licht schützende wirksame Menge eines Sonnenschutzmittels verwendet werden. Der Begriff "sicher und vor Licht schützend" bezieht sich auf eine ausreichende Menge, welche einen Lichtschutz bereitstellt, wenn die Zusammensetzung aufgetragen wird, der aber nicht so stark ist, daß Nebenwirkungen oder Hautreaktionen verursacht werden. Im allgemeinen kann das Sonnenschutzmittel 0,5 bis 20 Gew.-% der Zusammensetzung umfassen. Ein zusätzliches Sonnenschutzmittel kann 0,5 bis 30 Gew.-%, vorzugsweise 0,5 bis 20 Gew.-% der Zusammensetzung umfassen. Die genauen Mengen variieren abhängig von dem gewählten Sonnenschutzmittel und dem gewünschten Sonnenschutz-

15

20

25

30

Ethylhexyl-p-methoxyzinnamat, entweder allein oder in Kombination mit dem physikalischen Sonnenschutzmittel Titandioxid.

Der SPF ist ein üblicherweise verwendetes Lichtschutzmaß eines Sonnenschutzmittels gegen Hautrötung. Diese Zahl wird von einem anderen Parameter abgeleitet, der minimalen Hautrötungsdosis ("Minimal Erythemal Dose", MED). Die MED ist definiert als die "mittlere Expositionsdosis bei einer spezifischen Wellenlänge, welche eine verspätete Hautrötungsantwort auslöst". Die MED gibt die Menge der Energie, welche die Haut erreicht, und die Empfänglichkeit der Haut gegenüber der Strahlung an. Man erhält den SPF eines bestimmten Lichtschutzes, indem man die MED geschützter Haut durch die MED ungeschützter Haut dividiert. Je höher der SPF ist, desto wirksamer ist das Mittel bei der Vorbeugung vor Sonnenbrand. Der SPF-Wert sagt aus, wie viel länger eine Person bei der Verwendung des Sonnenschutzmittels in der Sonne bleiben kann (verglichen mit der gleichen Person bei ungeschützter Haut), bevor diese Person eine MED von 1 erfährt. Beispielsweise ermöglicht die Verwendung eines Sonnenschutzmittels mit einem SPF von 6 einem Individuum sechsmal länger in der Sonne zu bleiben bevor es eine MED von 1 davonträgt. Wenn der SPF-Wert eines Sonnenschutzmittels ansteigt, besteht eine geringere Chance für die Entwicklung von Hautbräune. Im Handel erhältliche Sonnenschutzmittel besitzen SPF-Werte im Bereich von 2 bis 50.

Ebenfalls besonders nützlich, entweder allein oder zusammen mit Ethylhexyl-p-methoxyzinnamat, sind Sonnenschutzmittel, wie jene, welche in der US-A-4,937,370 von Sabatelli, erteilt am 26. Juni 1990, offenbart wurden. Die darin offenbarten Sonnenschutzmittel besitzen in einem einzigen Molekül zwei verschiedene Chromophoreinheiten, welche unterschiedliche Ultraviolettstrahlungsabsorptionsspektren aufweisen. Die eine der Chromophoreinheiten absorbiert überwiegend im UVB-Strahlungsbereich und die andere absorbiert stark im UVA-Strahlungsbereich.

Diese Sonnenschutzmittel stellen eine höhere Wirksamkeit, eine breitere UV-Absorption, eine geringere Hautdurchdringung und eine länger anhaltende Wirksamkeit im Vergleich zu herkömmlichen Sonnenschutzmittel bereit.

Bevorzugte Angehörige dieser Klasse von Sonnenschutzmitteln sind der 4,N,N-(2-Ethylhexyl)methylaminobenzoesäureester von 2,4-Dihydroxybenzophenon; der N,N-Di-(2-ethylhexyl)-4-aminobenzoesäureester mit 4-Hydroxydibenzoylmethan; der 4-N,N-(2-Ethylhexyl)methylaminobenzoesäureester mit 4-Hydroxydibenzoylmethan; der 4-N,N-(2-Ethylhexyl)methylaminobenzoesäureester von 2-Hydroxy-4-(2-hydroxyethoxy)benzophenon; der 4-N,N-(2-Ethylhexyl)methylaminobenzoesäureester von 4-(2-Hydroxy-4-(2-hydro

10

15

20

25

2-Hydroxy-4-(2-hydroxyethoxy)benzophenon und der N,N-Di-(2-ethylhexyl)-4-amino-benzoesäureester von 4-(2-Hydroxyethoxy)dibenzoylmethan und Gemische davon.

Flüchtige, bei den erfindungsgemäßen Zusammensetzungen nützliche Silikonöle sind vorzugsweise zyklisch. Die folgende Formel veranschaulicht zyklische, flüchtige Polydimethylsiloxane, welche bei den hier offenbarten Zusammensetzungen nützlich sind

worin n einer Zahl von etwa 3 bis etwa 7 entspricht. Lineare Polydimethylsiloxane enthalten etwa 3 bis etwa 9 Silikonatome pro Molekül und besitzen die folgende allgemeine Formel

$$(\text{CH}_3)_3\text{Si-O-}[\text{Si}(\text{CH}_3)_2\text{-O}]_n\text{-Si}(\text{CH}_3)_3$$
 ,

worin n einer Zahl von etwa 1 bis etwa 7 entspricht. Lineare, flüchtige Silikonstoffe weisen im allgemeinen eine Viskosität von weniger als etwa 5 mm².s¹ (5 Centistokes) bei 25°C auf, während zyklische Stoffe üblicherweise eine Viskosität von weniger als etwa 10 mm².s¹ (10 Centistoke) besitzen. Eine Beschreibung der verschiedenen flüchtigen Silikonöle findet man bei Todd et al., "Volatile Silicone Fluids for Cosmetics", Cosmetics & Toiletries 91 (1976), 27-32.

Beispiele der hier nützlichen, bevorzugten flüchtigen Silikonöle umfassen: Dow Corning 344, Dow Corning 345 und Dow Corning 200 (hergestellt von Dow Corning Corp.); Silikon 7207 und Silikon 7158 (hergestellt von der Union Carbide Corp.); SF-1202 (hergestellt von General Electric) und SWS-03314 (hergestellt von SWS-Silicones, Inc.).

Die erfindungsgemäßen Zusammensetzungen umfassen vorzugsweise mindestens einen Weichmacher. Bevorzugte Weichmacher sind flüchtige Silikonöle, nicht flüchtige Weichmacher und die stark verzweigten, als Permethyl 99 (RTM) aus der 108A-Reihe (erhältlich von Permethyl Corporation) bekannten Kohlenwasserstoff und Mischungen davon. Die erfindungsgemäßen Zusammensetzungen umfassen stärker bevorzugt mindestens ein flüchtiges Silikonöl, welches als flüssiger Weichmacher wirkt, oder insbesondere ein Gemisch aus flüchtigen Silikonölen und nicht flüchtigen Weichmachern. Der hier verwendete Begriff "flüchtig" bezieht sich auf jene Stoffe, welche einen meßbaren

Die vorliegenden Zusammensetzungen enthalten vorzugsweise auch einen oder mehrere nicht flüchtige Weichmacher. Solche Stoffe umfassen Fettsäure- und Fettalkoholesterkohlenwasserstoffe und Mischungen davon. Hier nützliche Weichmacher werden in Cosmetics, Science and Technology 1 (1972), 27-104 (Balsam M. und Sagarin E., Hrsg.) und in der US-A-4,202,879 von Shelton, erteilt am 13. Mai 1980, beschrieben.

Hier als Weichmachersubstanz nützliche, unpolare Fettsäure- und Fettalkoholester umfassen zum Beispiel Di-isopropyladipat, Isopropylmyristat, Isopropylpalmitat, Ethylhexylpalmitat, Isodecylneopentanoat-C<sub>12</sub>-C<sub>15</sub>-Alkoholbenzoat, Diethylhexylmaleat, PPG-14-Butylether und PPG-2-Myristyletherpropionat. Kohlenwasserstoffe wie Isohexadecan (z.B. Permethyl 101A (RTM), geliefert von Presperse) sind ebenfalls als Weichmacher nützlich.

Die Weichmacher umfassen üblicherweise insgesamt 1 bis 50 Gew.-%, vorzugsweise 1 bis 25 Gew.-% und stärker bevorzugt 1 bis 10 Gew.-% der erfindungsgemäßen Zusammensetzungen.

- Ein wahlweiser Bestandteil der vorliegenden Zusammensetzungen ist ein Wachs. Nützliche Esterwachse umfassen C<sub>10</sub>-C<sub>40</sub>-Alkohole, verestert mit einer C<sub>10</sub>-C<sub>40</sub>-Fettsäure; Diester einer C<sub>10</sub>-C<sub>40</sub>-Fettsäure, wobei der Alkohol Propylenglykol, Ethylenglykol, Polyethylenglykol, Polypropylenglykol oder Polyglycerin ist; Pentaerythrit-tri- oder -tetraester der C<sub>10</sub>-C<sub>40</sub>-Fettsäuren; C<sub>10</sub>-C<sub>40</sub>-Fettsäuren der Sorbittriester, C<sub>10</sub>-C<sub>40</sub>-Fettsäuren der Saccharosepolyester mit einer Substitutionsrate von 3-8 Mol; Myristylmyristat; Paraffin, synthetische Wachse, wie Fischer-Tropsche-Wachse; mikrokristalline Wachse; Castorwachs; Behenylbehenrat und Myristylpropionat und Gemische davon. Nützliche Diesterwachse umfassen Synchrowachs ERL-C (RTM) (erhältlich von Croda) und Propylenglykoldiesterwachse, einschließlich Ethylenglykoldistearat und Glykoldistearat.
- 25 Erfindungsgemäß nützliche pharmazeutische Wirkstoffe umfassen jede zur topischen Verabreichung geeignete chemische Substanz oder Verbindung, welche die gewünschte topische oder systemische Wirkung induziert. Solche Substanzen umfassen, sind aber nicht darauf beschränkt, Antibiotika, Antivirusmittel, Schmerzmittel (z.B. Ibuprofen, Acetylsalicylsäure, Naproxen und ähnliche), Antihistamine, entzündungshemmende Mittel, juckreizlindernde Mittel, fiebersenkende Mittel, Narkosemittel, Diagnosemittel, Hormone, Fungizide, Bakteriostatika, Hautwachstumsverstärker, Pigmentmodulatoren, wachstumshemmende Mittel, gegen Psoriasis wirkende Mittel, Retinoide, Anti-Akne-Medikamente (z.B. Benzoylperoxid, Schwefel, etc.), das Tumorwachstum hemmende Mittel phototherapeutische Mittel und keralytische Mittel (z.B. Resorcinol, Salicylsäure)

und Gemische davon. Diese pharmazeutischen Wirkstoffe können den Emulsionen vorzugsweise in einer Menge von 0,1 bis 20 Gew.-% beigemischt werden.

In den erfindungsgemäßen Zusammensetzungen können verschiedene Vitamine eingeschlossen sein. Zum Beispiel können Vitamin A und Derivate davon, Ascorbinsäure, Vitamin B, Biotin, Panthothensäure, Vitamin D und Gemische davon verwendet werden. Auch Vitamin E, Tocopherolacetat und Derivate können verwendet werden.

#### Andere wahlweise Komponenten

10

15

Eine Vielzahl von zusätzlichen Bestandteilen können den erfindungsgemäßen Emulsionszusammensetzungen zugegeben werden. Diese zusätzlichen Bestandteile umfassen
verschiedene Polymere zur Unterstützung der Filmbildungseigenschaften und der
Beständigkeit der Zubereitung, Konservierungsmittel zur Aufrechterhaltung der antimikrobiellen Integrität der Zusammensetzungen, Antioxidationsmittel und für ästhetische
Zwecke geeignete Mittel, wie Duftstoffe, Pigmente und Farbstoffe.

Die folgenden Beispiele beschreiben und veranschaulichen weitere Ausführungsformen innerhalb des Schutzumfangs der vorliegenden Erfindung.

#### Beispiel I

Eine daraufbleibende Gesichtsemulsionszusammensetzung, welche ein kationisches, hydrophobes Tensid enthält, wird durch Vereinigen der folgenden Bestandteile unter Anwendung von herkömmlichen Mischverfahren hergestellt.

5	<u>Bestandteil</u>	<u>Gew%</u>
	Wasser	q.s.
	Glycerin	3,00
•	Cetylpalmitat	3,00
	Cetylalkohol	1,26
10	Quaternium-22 (RTM)	1,00
	Glycerylmonohydroxystearat	0,74
	Dimethicon	0,60
	Stearinsäure	0,55
	Octyldodecylmyristat	0,30
15	Kaliumhydroxid	0,20
	Carbomer 1342 (RTM)	0,125
	Tetranatrium-EDTA	0,10
	DMDM-Hydantoin und Iodpropynylbutylcarbamat	0,10
	Carbomer 951 (RTM)	0,075

20 Diese Emulsion ist zur Bereitstellung einer Regulierung der Sebumverteilung auf der Haut nützlich.

Die Verwendung einer Menge dieser Zusammensetzung, welche zur Ablagerung von etwa 2,0 mg/cm² auf der Haut ausreichend ist, ergibt einen Kontaktwinkel von 10° zwischen Sebum und Haut.

Die Geschwindigkeit der Sebumausbreitung für die Emulsion ist größer als 9500 Bildpunkte über einen Zeitraum von 0 bis 5 Minuten.

#### Beispiel II

Eine daraufbleibende Gesichtsemulsionszusammensetzung, welche sowohl ein kationisches, hydrophobes Tensid als auch ein nicht flüchtiges Organopolysiloxan enthält, wird durch Vereinigen der folgenden Bestandteile unter Anwendung von herkömmlichen Mischverfahren hergestellt.

<u>Gew%</u>
q.s.
3,00
3,00
1,26
1,00
0,74
0,60
0,55
0,50
0,30
0,20
0,125
0,10
0,10
0,075

Diese Emulsion ist zur Bereitstellung einer Regulierung der Sebumverteilung auf der Haut nützlich.

Die Verwendung einer Menge dieser Zusammensetzung, welche zur Ablagerung von etwa 2,0 mg/cm² auf der Haut ausreichend ist, ergibt einen Kontaktwinkel von 10° zwischen Sebum und Haut.

Die Geschwindigkeit der Sebumausbreitung für die Emulsion ist größer als 9500 Bildpunkte über einen Zeitraum von 0 bis 5 Minuten.

# Translation of the Claims of the European Patent No. 3 359 786 European Patent Application No. 92 901 503.0 RICHARDSON-VICKS, INC.

Case: 4301X Me/ja

#### Patentansprüche

- 1 l. Daraufbleibende Gesichtsemulsionszusammensetzung, welche frei an Fetten und Ölen und anionischen Tensiden ist, umfassend:
  - (a) 0.01 bis 5 Gew.-% eines kationischen Tensids;
  - (b) 0.1 bis 10 Gew.-% eines Organopolysiloxans mit einem Durchschnittsmolekulargewicht von 200 000;
  - (c) 0,01 bis 5 Gew.-% eines oder mehrerer Carbonsäurecopolymere;
  - (d) 1 bis 10 Gew.-% eines Feuchthaltemittels; und
  - (e) einen kosmetisch annehmbaren Träger.

5

15

20

.30 .

 Emulsion nach Anspruch 1, wobei das kationische Tensid ein N.N.N-Trialkylaminoalkylenglukonamid der Formel

$$\begin{bmatrix} 0 & R \\ \frac{1}{2} - (C4CH)_4 - \frac{1}{2} - \frac{1}{2}H - (C4_2)_n - \frac{1}{2} - C4_2C4_2CH \end{bmatrix} + X^{-1}$$

ist, worin R = Alkyl,  $X = Cl^-$  oder  $Br^-$  und n eine ganze Zahl von 2 bis 4 ist, wobei vorzugsweise das kationische Tensid Glukonamidopropyl-dimethyl-2-hydroxyethyl-ammoniumchlorid ist.

- 3. Emulsion nach Anspruch 2, wobei das Feuchthaltemittel ein C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Diol oder -Triol ist, wobei das Feuchthaltemittel vorzugsweise Glycerin ist.
- 25 4. Emulsion nach Anspruch 3, wobei das Gewichtsverhältnis von Carbonsäurecopolymer zu Glukonamid 1:10 bis 10:1 beträgt.
  - 5. Emulsion nach Anspruch 4, wobei die Emulsion weiterhin 0,1 bis 20 Gew.-% eines pharmazeutischen Wirkstoffs umfaßt.
  - 6. Emulsion nach mindestens einem der Ansprüche 1 bis 5, wobei die Emulsion weiterhin 0.5 bis 20 Gew.-% eines Sonnenschutzmittels umfaßt, wobei das Sonnenschutzmittel vorzugsweise aus der Ethylhexyl-p-methoxyzinnamat.

- Octocrylen und 2-Ethylhexyl-N.N-dimethylaminobenzoat umfassenden Gruppe gewählt ist, wobei das Sonnenschutzmittel weiter vorzugsweise 2-Ethylhexyl-p-methoxyzinnamat ist.
- 5 7. Emulsion nach Anspruch 6, wobei die Emulsion weiterhin 0,5 bis 30 Gew.-% Titandioxid umfaßt.
  - 8. Emulsion nach mindestens einem der Ansprüche 1 bis 7, wobei das Organopolysiloxan aus der Dimethiconcopolyol, Dimethylpolysiloxan, Diethylpolysiloxan, Dimethicon, gemischtes C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>-Alkylpolysiloxan, Phenyldimethicon, Dimethiconol und Mischungen davon umfassenden Gruppe gewählt ist.
- Kosmetisches Verfahren zur Regulierung der Sebumverteilung auf der Gesichtshaut, welches Verfahren die topische Anwendung auf der Gesichtshaut einer wirksamen Menge einer Emulsionszusammensetzung nach mindestens einem der Ansprüche 1 bis 8 umfaßt.

25

30

# This Page is Inserted by IFW Indexing and Scanning Operations and is not part of the Official Record

### **BEST AVAILABLE IMAGES**

Defective images within this document are accurate representations of the original documents submitted by the applicant.

Defects in the images include but are not limited to the items checked:

□ BLACK BORDERS
☐ IMAGE CUT OFF AT TOP, BOTTOM OR SIDES
☐ FADED TEXT OR DRAWING
☐ BLURRED OR ILLEGIBLE TEXT OR DRAWING
SKEWED/SLANTED IMAGES
☐ COLOR OR BLACK AND WHITE PHOTOGRAPHS
☐ GRAY SCALE DOCUMENTS
☐ LINES OR MARKS ON ORIGINAL DOCUMENT
☐ REFERENCE(S) OR EXHIBIT(S) SUBMITTED ARE POOR QUALITY
OTHER:

### IMAGES ARE BEST AVAILABLE COPY.

As rescanning these documents will not correct the image problems checked, please do not report these problems to the IFW Image Problem Mailbox.